

7/5/4

Fulltext available through: [Order File History](#)

Derwent WPI

(c) 2010 Thomson Reuters. All rights reserved.

0010691465

WPI Acc no: 2001-301215/200132

XRAM Acc no: C2001-092624

Composition for treating malabsorption and AIDS comprises an alginate preparation, a radical scavenger and an absorbent

Patent Assignee: ELORISAN GMBH (ELOR-N); ELORISAN GMBH IK (ELOR-N); REICHEL I (REIC-I); SCHUETTE/REICHEL GBR VERTRETUNGSBERECHTI (SCHU-N)

Inventor: GRADL A; GRADL T

Patent Family (4 patents, 89 countries)

Patent Number	Kind	Date	Application Number	Kind	Date	Update	Type
DE 19940011	A1	20010301	DE 19940011	A	19990824	200132	B
WO 2001014468	A1	20010301	WO 2000EP8136	A	20000821	200132	E
AU 200074109	A	20010319	AU 200074109	A	20000821	200136	E
DE 19940011	B4	20090402	DE 19940011	A	19990824	200924	E

Priority Applications (no., kind, date): DE 19940011 A 19990824

Patent Details

Patent Number	Kind	Lan	Pgs	Draw	Filing Notes
DE 19940011	A1	DE	5	0	
WO 2001014468	A1	DE			
National Designated States, Original	AE AL AM AT AU AZ BA BB BG BR BY CA CH CN CR CU CZ DE DK DM EE ES FI GB GD GE GH GM HR HU ID IL IN IS JP KE KG KP KR KZ LC LK LR LS LT LU LV MA MD MG MK MN MW MX NO NZ PL PT RO RU SD SE SG SI SK SL TJ TM TR TT TZ UA UG US UZ VN YU ZA ZW				
Regional Designated States, Original	AT BE CH CY DE DK EA ES FI FR GB GH GM GR IE IT KE LS LU MC MW MZ NL OA PT SD SE SL SZ TZ UG ZW				
AU 200074109	A	EN			Based on OPI patent WO 2001014468

Alerting Abstract DE A1

NOVELTY - Composition comprising an alginate preparation, a radical scavenger and an absorbent is new.

ACTIVITY - Anti-HIV.

An AIDS patient not receiving other medication was treated three times a day for 3 months with tablets (450 mg) comprising brown seaweed powder (78.35%), finely divided silica (5.7%), deoiled cocoa powder (0.95%) and tableting aid (1.5%). The virus load before/after treatment was 284,000/218,795 (units not given).

MECHANISM OF ACTION - None given.

USE - The composition is useful for treating malabsorption and acquired immunodeficiency syndrome (AIDS).



⑮ BUNDESREPUBLIK
DEUTSCHLAND



DEUTSCHES
PATENT- UND
MARKENAMT

⑫ **Offenlegungsschrift**
⑩ **DE 199 40 011 A 1**

⑤① Int. Cl.⁷:
C 08 B 37/04
A 61 K 31/715
A 61 K 31/695
A 61 P 1/00

⑳ Aktenzeichen: 199 40 011.3
㉔ Anmeldetag: 24. 8. 1999
㉓ Offenlegungstag: 1. 3. 2001

DE 19940 011 A 1

Mit Einverständnis des Anmelders offengelegte Anmeldung gemäß § 31 Abs. 2 Ziffer 1 PatG

⑦① Anmelder:
Elorisan GmbH i.K., 94469 Deggendorf, DE

⑦④ Vertreter:
Spitz, Klinger & Partner GbR, 80336 München

⑦② Erfinder:
Gradl, Toni, Dr., 94371 Rattenberg, DE

Die folgenden Angaben sind den vom Anmelder eingereichten Unterlagen entnommen

- ⑤④ Alginataufbereitung und deren Verwendung
⑤⑦ Gegenstand der Erfindung ist eine Mischung, enthaltend eine Alginataufbereitung mit Alginsäure und/oder Derivaten, wahlweise in Form der Salze, sowie mindestens einen Radikalfänger und mindestens ein Absorptionsmittel. Die Mischung dient zur Behandlung der Malabsorption, insbesondere auch der Krankheit AIDS.

DE 19940 011 A 1

DE 199 40 011 A 1

Beschreibung

Die Erfindung betrifft eine Alginataufbereitung, enthaltend Alginsäure und/oder deren Derivate, wahlweise in Form der Salze, sowie die Verwendung der Alginataufbereitung.

- 5 Aus der DE-A 44 35 525 ist ein Präparat zur Behandlung von Entmarkungsenzephalitiden sowie zur protektiven Immunstimulation bekannt. Dieses Präparat dient zur Stärkung des Immunsystems durch eine Behandlung mit Alginsäure in Kombination mit bestimmten Kationen. Das Präparat wird oral verabreicht.

- Eine Reihe von Krankheitszuständen ist jedoch dadurch gekennzeichnet, daß die Immunabwehr im Darm von Wirbeltieren nicht ausreichend funktioniert und infolgedessen krankmachende Erreger die Darmzotten schädigen oder sogar in den Körper eindringen können. Die Reaktion des Körpers darauf ist in der Regel ein Durchfall, gefolgt von der Unfähigkeit, genügend Stoffe aus der Nahrung zu absorbieren (Malabsorption). Eine Folge dieses Mangels ist eine ungenügende Versorgung mit bestimmten Aminosäuren, so daß sich nicht genügend immunmodulatorische Proteine bilden, was zu einer weiteren Schwächung der Immunabwehr führt. Dieser pathogene Mechanismus ist unter anderem für den Krankheitsverlauf der erworbenen Immunschwäche (AIDS, acquired immune deficiency syndrome) mitentscheidend, wenn er

- 15 ihr nicht überhaupt, wofür gewisse Indizien sprechen, zugrunde liegt.

Die orale Applikation des aus der DE-A 44 35 525 bekannten Präparats ist in diesen Fällen von Malabsorption jedoch nicht möglich, da der Stoff zu schnell ausgeschieden und dadurch in zu geringen Mengen aufgenommen wird.

- Aufgabe der Erfindung ist es daher, eine Mischung bzw. ein Präparat, enthaltend eine Alginataufbereitung mit Alginsäure und/oder deren Derivaten, wahlweise in Form der Salze, bereitzustellen, welche auch in Fällen der Malabsorption oral verabreicht werden kann.

Darüber hinaus ist es Aufgabe der Erfindung, eine Mischung bzw. ein entsprechendes Präparat bereitzustellen, das gegenüber dem aus dem Stand der Technik bekannten Präparat bzw. der Mischung eine verbesserte Wirkung zeigt.

- Diese Aufgabe wird durch eine Mischung, enthaltend eine Alginataufbereitung mit Alginsäure und/oder deren Derivaten, wahlweise in Form der Salze, sowie mindestens einen Radikalfänger und mindestens ein Absorptionsmittel, gelöst.

Bevorzugterweise enthält die erfindungsgemäße Alginataufbereitung eine teilweise silylierte Alginsäure. Im stärker bevorzugten Falle liegt der Silylierungsgrad der Alginsäure zwischen 0,3 und 0,7 [Mol Silicium pro Mol Uronsäuremonomer], am bevorzugtesten aber im Bereich von 0,4 Mol bis 0,6 Mol Silicium pro Uronsäuremonomer.

- Das in der erfindungsgemäßen Mischung enthaltene Absorptionsmittel ist bevorzugt ausgewählt aus der Gruppe, bestehend aus Kieselsäure, Bentonit und Kaolinit. Besonders bevorzugt ist eine Kieselsäure, die hochdispers ist; insbesondere handelt es sich um eine hochdisperse Kieselsäure, bei der die Teilchen einen mittleren Durchmesser im Bereich von 10 bis 20 nm aufweisen. Der SiO_2 -Gehalt der Kieselsäure beträgt mehr als 95%, insbesondere 99,8%.

- Die erfindungsgemäße Mischung enthält neben dem Absorptionsmittel noch einen Radikalfänger, d. h. ein Radikale abfängendes Agens. Bevorzugt handelt es sich bei dem Radikalfänger um einen Stoff, der ausgewählt ist aus der Gruppe der Catechine und der hydrolysierbaren Gallotannine. Natürlich kann auch eine Mischung dieser Stoffe erfindungsgemäß eingesetzt werden. Bevorzugterweise sind in der Mischung Catechine und/oder hydrolysierbare Gallotannine enthalten, die aus den Naturstoffen Hemlockrinde, Gambir, Catechu, Quebracho, Kino, Mimosarinde, Mangrovenrinde, Kino, Divi-Divi, Eichenrinde, Tizera, Föhrenrinde, Kastanienholz, Valonea, Myrobalanen, Trillo sowie aus Teaflavin erhältlich sind.

- In einem besonders bevorzugten Falle handelt es sich bei dem Radikalfänger um ein Polyalkylphenol. In dem am stärksten bevorzugten Falle handelt es sich um ein Polyalkylphenol aus einer Kakaomasse, das dadurch erhältlich ist, daß man eine Kakaomasse einem Verfahren mit den Schritten unterzieht, wobei eine Kakaorohmasse teilweise bei 90 bis 100°C hydraulisch entfettet und der erhaltene Preßkuchen vermahlen wird. Natürlich kann ein derartiges Verfahren, durch das das erfindungsgemäß am stärksten bevorzugte Polyalkylphenol erhältlich ist, auch durch weitere Verfahrensschritte modifiziert werden, die dem Fachmann vertraut sind.

- Die erfindungsgemäße Mischung enthält die Alginataufbereitung in einem Anteil von bevorzugt 70 bis 80 Gew.-%, den Radikalfänger in einem Anteil von bevorzugt 0,7 bis 1 Gew.-%, das Absorptionsmittel in einem Anteil von bevorzugt 3 bis 6 Gew.-%, Rest 26,3 bis 13 Gew.-%.

- Wie bereits erwähnt wird die Mischung erfindungsgemäß in einem Heilverfahren eingesetzt, insbesondere zur Behandlung der Malabsorption. Besonders bevorzugt besteht die Verwendung darin, daß mit der erfindungsgemäßen Mischung Patienten behandelt werden, die an AIDS erkrankt sind. Die erfindungsgemäße Mischung bzw. das Einsatzgebiet wird durch das nachfolgende Beispiel näher erläutert, das jedoch nicht einschränkend zu verstehen ist.

Beispiel

- 55 Für das Beispiel wurden Fälle von AIDS im Vollbild gewählt, da die Malabsorption bei diesem Krankheitsbild (verbunden mit chronischen Durchfällen und starken Gewichtsverlusten) in der Medizin als äußerst schwierig zu behandeln gilt.

Eine prospektive Studie zur Beurteilung der Wirksamkeit der Nahrungsergänzung aus:

- 60 78,35% Braunalgenpulver
5,7% hochdisperse Kieselsäure als SiO_2
0,95% Kakaopulver, leicht entölt
1,5% Tablettierhilfsstoff
gepreßt zu Tabletten von je 450 mg
65 bei AIDS-Patienten.

DE 199 40 011 A 1

Indikation

Männliche und weibliche HIV-1 infizierte Patienten im Vollbild von AIDS

Studienziel

5

Bestimmung der Auswirkung des Stoffgemisches auf Krankheitssymptome (Gastrointestinalstörungen, Wasting Syndrom, Chronic Fatigue Syndrom, Fitness) sowie Laborparameter (Virus load, CD4+ -Zellzahl) von AIDS-Patienten.

Studiendesign

10

Offene, nicht placebokontrollierte Studie bei 9 ambulant behandelten AIDS-Patienten.

Studiendauer

15

April 1999 – Juni 1999 (3 Monate).

Ein- und Ausschlusskriterien

Einschlusskriterien:

20

Patienten mit weniger als 400 CD4+/(1 Blut)

Vollbild AIDS

Alter 20–50 Jahre

HIV-1-Infektion

Verstehen des Studienablaufs

25

Schriftliche Einverständniserklärung

Ausschlusskriterien:

Endstadium

Schwangerschaft

Unzuverlässige Einnahme

30

Angaben zur Studienmedikation

Es wurden 3 mal täglich 1 Tablette (450 mg) eingenommen.

35

Vorgehen

Nach Überprüfung der Ein- und Ausschlusskriterien erhielten sowohl der behandelnde Arzt als auch der Patient einen Dokumentationsbogen. Während der gesamten Studiendauer wurden wochenweise folgende Krankheitssymptome dokumentiert:

40

Kopfschmerzen, Lymphknotenschwellung, Mattigkeit, Nachtschweiß, Durchfall, Augenschmerzen, Atembeschwerden, weißer Belag im Mund, weißer Scheidenausfluß, Körpertemperatur und Körpergewicht Die Laborparameter (Virus load, CD4+) wurden am Anfang und am Ende der Studie bestimmt.

Studienergebnisse

45

Die nachfolgende Tabelle zeigt eine Übersicht der Studienergebnisse. Von den 9 Patienten schied einer wegen unzuverlässiger Einnahme aus.

Die Laborparameter (virus load, CD4+) zeigten weder positive noch negative Änderungen, verhielten sich relativ konstant und sind folglich auch nicht auswertbar. In der jeweiligen Spalte sind die Werte zu Beginn und am Ende der Studie aufgeführt.

50

Die klinischen Symptome wurden mittels einer Skala von 0 bis 4 (ohne – sehr stark) bewertet. Als besonders signifikant hervorzuheben sind die Änderungen in Bezug auf die Durchfälle und Mattigkeit. Die Durchfälle hatten sich bei allen 8 Patienten nach 3–4 Wochen verbessert und waren zum Studienende vollkommen verschwunden. In der Tabelle sind die Werte bei Studienbeginn und Studienende dokumentiert. Die Mattigkeit war eine weitere Symptomatik, die sich signifikant verbessert hat. Alle übrigen klinischen Symptome änderten sich nicht signifikant und sind deshalb in der Tabelle nicht aufgeführt.

55

60

65

DE 199 40 011 A 1

Alter	Geschlecht	Patient	Arzt	Begleit- medikation	Virus load Beginn/Ende	CD4+ Beginn/Ende	HIV+ seit	Durchfälle	Mattigkeit
35	M	L.R.	Arzt 1	Ja (1)	< 50/< 40	394/390	1995	Mittel/ohne	Mittel/ohne
44	W	G.M.	Arzt 1	Ja (2)	230/5500	241/223	1991	Mittel/ohne	Stark/ohne
41	M	M.I.	Arzt 1	Ja (3)	2800/3900	306/369	1995	Mittel/ohne	Mittel/etwas
35	W	G.	Arzt 2	Nein	132392/n.b.	390/530	1991	Stark/ohne	Keine
35	M	J.	Arzt 2	Nein	284000/218795	210/210	1990	Sehr stark/ohne	Keine
26	M	Si	Arzt 2	Nein	80763/33559	630/420	1992	Stark/ohne	Keine
44	M	Se	Arzt 2	Nein	560/< 50	260/290	1991	Stark/ohne	Mittel/ohne
36	M	R.	Arzt 2	Nein	5390/5000	200/200	1993	Stark/ohne	Mittel/ohne

n.b. = nicht bestimmt

DE 199 40 011 A 1

Patentansprüche

1. Mischung, enthaltend eine Alginataufbereitung mit Alginsäure und/oder deren Derivaten, wahlweise in Form der Salze, sowie mindestens einen Radikalfänger und mindestens ein Absorptionsmittel.
2. Mischung nach Anspruch 1, wobei die Alginataufbereitung eine teilweise silylierte Alginsäure enthält. 5
3. Mischung nach Anspruch 2, wobei der Silylierungsgrad der Alginsäure zwischen 0,3 und 0,7 [Mol Silizium/Mol Uronsäuremonomer], vorzugsweise aber im Bereich von 0,4 mol bis 0,6 mol Silizium/Uronsäuremonomer liegt.
4. Mischung nach einem der vorhergehenden Ansprüche, wobei das Absorptionsmittel ausgewählt ist aus der Gruppe, bestehend aus Kieselsäure, Bentonit und Kaolinit.
5. Mischung nach Anspruch 4, wobei die Kieselsäure hochdispers ist, bevorzugt mit einem Teilchendurchmesser im Bereich von 10 bis 20 nm. 10
6. Mischung nach Anspruch 4 oder 5, wobei der SiO_2 -Gehalt der Kieselsäure größer als 95% ist.
7. Mischung nach einem der vorhergehenden Ansprüche, wobei der Radikalfänger ausgewählt ist aus der Gruppe der Catechine und hydrolysierbaren Gallotannine.
8. Mischung nach Anspruch 7, wobei die Catechine und hydrolysierbaren Gallotannine aus den Naturstoffen Hemlockrinde, Gambir, Catechu, Quebracho, Kino, Mimosa- und Mangrovenrinde, Kino, Divi-Divi, Eichenrinde, Tizera, Föhrenrinde, Kastanienholz, Valonea, Myrobalanen, Trillo sowie aus Teaflavin erhältlich sind. 15
9. Mischung nach einem der vorhergehenden Ansprüche, wobei es sich bei dem Radikalfänger um ein Polyalkylphenol handelt.
10. Mischung nach Anspruch 9, wobei das Polyalkylphenol erhältlich ist, indem Kakaomasse einem Verfahren mit den Schritten unterzogen wird, wobei eine Kakaorohmasse teilweise bei 90–100°C hydraulisch entfettet und der erhaltene Presskuchen gemahlen wird. 20
11. Mischung nach einem der vorhergehenden Ansprüche, enthaltend die Alginataufbereitung in einem Anteil von 70–80 Gewichtsprozent, den Radikalfänger in einem Anteil von 0,7 bis 1 Gewichtsprozent, das Absorptionsmittel in einem Anteil von 3% bis 6%, Rest 26, 3 bis 13 Gewichtsprozent. 25
12. Mischung nach einem der vorhergehenden Ansprüche zur Verwendung in einem Heilverfahren, insbesondere zur Behandlung von Malabsorption.
13. Mischung nach einem der Ansprüche 1 bis 8 zur Verwendung bei einer Behandlung von AIDS.

30

35

40

45

50

55

60

65

- Leerseite -